Docket No. 245698US0

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

IN RE APPI	LICATION OF: Atsushi S	UZUKI, et al.	GA	U:
SERIAL NO	:NEW APPLICATION		EX	AMINER:
FILED:	HEREWITH			
FOR:	MINERAL ABSORPTIC	N ENHANCER		
		REQUEST FOR PRICE	RITY	
	ONER FOR PATENTS RIA, VIRGINIA 22313			
SIR:				
	efit of the filing date of U.S. ns of 35 U.S.C. §120.	S. Application Serial Number	, filed	, is claimed pursuant to the
☐ Full ben §119(e)		U.S. Provisional Application(s) <u>Application No.</u>	is claimed purs <u>Date File</u>	suant to the provisions of 35 U.S.C.
	nts claim any right to prior risions of 35 U.S.C. §119, a		itions to which	they may be entitled pursuant to
In the matter	r of the above-identified ap	plication for patent, notice is he	reby given that	the applicants claim as priority:
COUNTRY Japan	, -	APPLICATION NUMBER 2002-342134		NTH/DAY/YEAR ember 26, 2002
	pies of the corresponding Cubmitted herewith	Convention Application(s)		·
□ will	be submitted prior to paym	ent of the Final Fee		
□ were	filed in prior application S	Serial No. filed		
Rece	e submitted to the Internation cipt of the certified copies be owledged as evidenced by		Number timely manner	under PCT Rule 17.1(a) has been
□ (A).	Application Serial No.(s) w	ere filed in prior application Se	rial No.	filed ; and
□ (B)	Application Serial No.(s)			
	are submitted herewith			
	will be submitted prior to	payment of the Final Fee		
	•		Respectfully S	Submitted,
				VAK, McCLELLAND, CUSTADT, P.C.
			Norman F. Ob	Jmm M Gullans
Customer	Number		Registration N	
228	50		<u> </u>	

Tel. (703) 413-3000 Fax. (703) 413-2220 (OSMMN 05/03)

C. Irvin McClelland Registration Number 21,124

日本国特許庁 JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日 Date of Application:

2002年11月26日

出 願 番 号 Application Number:

人

特願2002-342134

[ST. 10/C]:

[J P 2 0 0 2 - 3 4 2 1 3 4]

出 願
Applicant(s):

花王株式会社

2003年10月14日

特許庁長官 Commissioner, Japan Patent Office 今井康



【書類名】 特許願

【整理番号】 P05411411

【あて先】 特許庁長官 殿

【国際特許分類】 A61K 7/00

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県芳賀郡市貝町赤羽2606 花王株式会社研究所

内

【氏名】 鈴木 淳

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県芳賀郡市貝町赤羽2606 花王株式会社研究所

内

【氏名】 落合 龍史

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県芳賀郡市貝町赤羽2606 花王株式会社研究所

内

【氏名】 時光 一郎

【特許出願人】

【識別番号】 000000918

【氏名又は名称】 花王株式会社

【代理人】

【識別番号】 110000084

【氏名又は名称】 特許業務法人アルガ特許事務所

【代表者】 有賀 三幸

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 164232

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【プルーフの要否】 要

【書類名】 明細書

【発明の名称】 ミネラル吸収促進剤

【特許請求の範囲】

【請求項1】 コーヒー生豆抽出物を含有するミネラル吸収促進剤。

【請求項2】 ミネラルが、鉄、亜鉛、カルシウム及びマグネシウムから選ばれる1種以上である請求項1又は2記載のミネラル吸収促進剤。

【発明の詳細な説明】

 $[0\ 0\ 0\ 1\]$

【発明の属する技術分野】

本発明は、安全性に優れ、かつ優れたミネラル吸収促進作用を有し、ミネラル 不足を解消することができるミネラル吸収促進剤に関する。

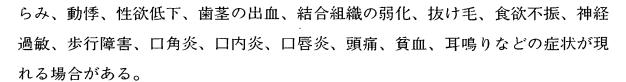
 $[0\ 0\ 0\ 2]$

【従来の技術】

医学、栄養学あるいは食品科学の分野で重要な微量元素は、主要ミネラルとされるナトリウム、カリウム、塩素、カルシウム、マグネシウム、リン、硫黄の他に、鉄、亜鉛、銅、マンガン、コバルト、クロム、ヨウ素、モリブデン、セレンの16種類の金属元素である。これらのミネラルは必須金属あるいは必須ミネラルと呼ばれ、微量ながら摂取に必要不可欠な元素で、身体の外から補給しなければならない。しかしながら、平成10年国民栄養調査(厚生労働省「平成10年度国民栄養の現状」)によれば、これまでも不足と言われ続けているカルシウムはもとより、若年女性における鉄摂取量の不足が危惧されている。

[0003]

ミネラルは生体にとって重要な働きをする一方で、不足した場合には固有の欠乏症が現れる。例えば、鉄の場合、血液の質的改善、赤血球の形成、抗ストレス、感染症防御、粘膜強化、結合組織の強化、免疫力の向上、疾病の抵抗力強化、成長促進、ビタミンB群の代謝促進、酸素循環の改善、脳細胞の活性化、エネルギーの産生などの効果がある。その一方で、鉄が不足すると、むくみ、発育不全、寝起きが悪い、軟骨の変形、湿疹、活力低下、粘膜の乾燥、めまい、肩こり、注意力の低下、免疫力の低下、息切れ、皮膚の蒼白、疲れやすい、冷え、立ちく



[0004]

また、亜鉛の作用としては、糖質の消化作用、蛋白質の合成、ビタミンB₁や蛋白質代謝の補助、性器官の生育・成熟、インスリン合成、脳の機能向上、創傷の治癒を早める、ビタミンAの適性代謝、骨の形成などがある。一方、亜鉛の不足は、発育不良、冷え性、創傷が治りにくい、学習能力の低下、性機能低下、味覚・嗅覚障害、前立腺肥大、動脈硬化、コレステロール蓄積、感染抵抗力の低下、脱毛、痛風、白血病、ガン、心臓病の誘発、糖尿病、シミなどの症状を引き起こす場合がある。

[0005]

さらにカルシウムの働きとしては、骨・歯の形成、心臓の機能維持、筋肉の収縮、過敏症・ストレス・生理痛の緩和、血液凝固促進、体内の水分量調整、排卵機能の向上などである。その一方でカルシウムが不足すると、骨軟化症、骨粗鬆症、歯の発育不順、くる病、動悸、不眠症、神経症、関節炎、高血圧、動脈硬化、血液の凝固不全、ぜんそく、鼻アレルギーなどの症状が現れる場合がある。

[0006]

また、マグネシウムの作用としては、細胞内の浸透圧の調節、酸・アルカリのバランス調整、ビタミンA・B群・C・D・E・カルシウムの吸収を助ける、コレステロールの沈着を防ぐ、精神を和らげる、皮膚をきれいにする、腎石の治療、糖尿病予防、アルコール中毒予防などが挙げられる。反対にマグネシウムの不足は、発育不全、極度の過敏症、筋肉のこり、ひきつけ、狭心症、心筋梗塞、腎不全、顔色が悪くなる、動脈硬化、血栓症、てんかん、白血病、ガンなどを誘発する場合がある。

[0007]

現状において、不足しているミネラルは、これらを含む錠剤、顆粒剤、液剤などの形態で、食間・食後などの時期に補給・摂取されている。しかし、これらミネラルの一部、例えば、鉄の吸収は緑茶やハーブのカテキン、コーヒーのクロロ

ゲン酸、ココアやワインのポリフェノールなどによって阻害されることが報告されている(非特許文献 1 参照)。さらにコーヒーの場合、鉄のみならず亜鉛の吸収を阻害することも報告されている(非特許文献 2 参照)。このような背景から、長年にわたり鉄剤服用者に対してお茶やコーヒーなどの飲料の摂取を禁止する指導がなされてきた(非特許文献 3 参照)。

[0008]

他方、近年、ペットボトル飲料や缶飲料の普及に伴い、全ての年代層に茶やコーヒーが広く飲まれており、上述したような若年女性の潜在性鉄欠乏の危惧を考慮すると、ミネラル不足は早急に解決すべき課題である。

[0009]

【非特許文献1】

Brune M, Rossander L, Hallberg L, 「Iron absorption and phenolic compounds: Importance of different phenolic structures.」, European Journal of Clinic and Nutrition, 1989年,第43巻,p.547-558

【非特許文献2】

Coudray C, Bousset C, Tressol J, Pepin D, Rayssiguire Y 「Short-term i ngestion of chlorogenic or caffeic acids decreases zinc but not copper a bsorption in rats, utilization of stable isotopes and inductively-couple d plasma mass spectrometry technique.」,British Journal of Nutrition,1 998年,第80巻,p.575-584

【非特許文献3】

石橋丸應,本屋敏郎,「図説 薬の体内動態(13)」,薬局,1988年,第39巻 ,p.113-117

[0010]

【課題を解決するための手段】

このような現状に鑑み、本発明者はミネラルの吸収を促進するような天然素材を広く探索したところ、驚くべきことにコーヒー生豆の抽出物を摂取することによって食品中に存在するミネラルの吸収性が著しく向上することを見出した。

$[0\ 0\ 1\ 1]$

すなわち、本発明はコーヒー生豆抽出物を含有するミネラル吸収促進剤を提供 するものである。

[0012]

【発明の実施の形態】

本発明に用いるコーヒー生豆抽出物は、例えばアカネ科コーヒー(Coffea ara bica LINNE)の種子より、熱水で抽出して得られたものが好ましい。本発明におけるコーヒー生豆抽出物は、例えば特開平6-38723号公報あるいは特開平10-183164号公報に開示されている方法により得ることができる。例えば、粉砕したコーヒー生豆に含水エタノール又は水を添加して、例えば約60℃~約100℃で、約1時間から約10時間加熱し冷却後、不溶性固形分を分離、加水分解処理、多孔性重合樹脂処理等を行うことにより得ることができる。あるいは上記抽出物を加水分解処理することなくそのまま溶媒を回収して濃縮し、次いで重合樹脂で吸着処理することにより本発明で利用するコーヒー抽出物を得ることができる。このようにして得られたコーヒー生豆抽出物は、クロロゲン酸類換算で約25重量%~約70重量%のクロロゲン酸及びカフェ酸及びフェルラ酸の混合物又はクロロゲン酸及びクロロゲン酸同族体の混合物を含有する。本発明に用いるコーヒー生豆抽出物に含まれるクロロゲン酸類、即ちクロロゲン酸同族体には、クロロゲン酸、ネオクロロゲン酸、クリプトクロロゲン酸、イソクロロゲン酸、フェリルキナ酸などの異性体が含まれる。

[0013]

コーヒー生豆抽出物は、後記試験例に示すようにミネラルの消化吸収を促進させる作用を有し、ミネラル吸収促進剤として有用であり、かつ安全性も高いのでミネラル不足を予防又は治療するための医薬、飲食品、特定保健用食品、医薬部外品として有用である。従来煎じたコーヒー豆の抽出物に鉄や亜鉛の吸収を阻害作用のあることが知られていることを考慮すれば、本発明は全く予想外である。

[0014]

本発明のミネラル吸収促進剤は、クロロゲン酸、カフェ酸及びフェルラ酸を含有するコーヒー生豆抽出物をそのままの形態もしくは乾燥固化した形態で用いてもよいし、又はコーヒー生豆抽出物を適当な希釈剤又は担体との組成物の形態で

あってもよい。希釈剤又は担体の例としては、グルコース、シュークロース、デキストリン、サイクロデキストリン、アラビアガム等の固体希釈剤又は担体;水、エタノール、プロピレングリコール、グリセリン、界面活性剤等の液体希釈剤又は担体を挙げることができる。かかる希釈剤又は担体を用いて液状、乳液状、ペースト状、粉末状、顆粒状その他適宜の剤型とすることができる。

[0015]

本発明のミネラル吸収促進剤を食品として用いる場合、当該食品の形態には特に制限はなく、有効成分の他に慣用の食品添加物を加えたジュース、コーヒー等の飲料;スープ等の液状食品;牛乳、カレー等の乳状又はペースト状食品;ゼリー、グミ等の半固形状食品;ガム、豆腐、サプリメント等の固形状食品、あるいは粉末状食品;マーガリン、マヨネーズ、ドレッシング等の油脂含有食品等いかなる形態でもよい。

$[0\ 0\ 1\ 6]$

本発明のミネラル吸収促進剤を医薬として用いる場合、上記有効成分そのもの、又は有効成分に薬学的に許容される担体を添加して、経口用組成物とすることができる。経口用組成物としては、錠剤、顆粒剤、細粒剤、丸剤、散剤、カプセル剤(硬カプセル剤及び軟カプセル剤を含む)、トローチ剤、チュアブル剤、液剤(ドリンク剤)などが挙げられる。

$[0\ 0\ 1\ 7]$

本発明のミネラル吸収促進剤は、有効成分であるコーヒー生豆抽出物を好ましくは 0.01 重量% ~ 100 重量%、さらに好ましくは 0.1 重量% ~ 50 重量%で含有する組成物として使用される。また、本発明に用いるコーヒー生豆抽出物の成人(体重 60 kg)での有効投与量は、特に制限はないが、1 日に 0.01 ~ 100 g、特に 0.05 ~ 10 g を摂取するようなものであることが好ましい

[0018]

【実施例】

以下の実施例において%は重量%を意味する。

実施例1 軟カプセル剤皮組成

ゼラチン 70.0%

グリセリン 22.9%

パラオキシ安息香酸メチル 0.15%

パラオキシ安息香酸プロピル 0.51%

水 適量

計 100%

上記組成からなる軟カプセル剤皮(オバール型、重さ150mg)の中に大豆油400 mgとコーヒー生豆抽出物100mgを定法により充填し、軟カプセル剤を製造した。

[0019]

実施例2

次に飲料としての実施例を示す。

脱脂粉乳 3.5%

ミルクカゼイン酵素分解物 3.5%

フラクトース 9.0%

コーヒー生豆抽出物 0.2%

クエン酸 0.1%

アスコルビン酸 0.1%

香料 0.1%

水 83.5%

計 100%

上記組成の飲料の保存安定性は高く、また、風味的には何ら問題のないことが分かった。

[0020]

<u>実施例3</u>

次に小麦粉製品への応用例を示す。

菜種油 15 g

コーンスターチ 19g

小麦粉 50 g

バター 5g

フラクトース 14g

コーヒー生豆抽出物 2g

食塩 0.5g

重層 0.5g

水 10 g

定法により、上記組成から成るクッキーを焼成した。

[0021]

試験例

<方法> 試験にはSD系雄性ラット(8週齢)を用いた。コントロール食として市販固形食(オリエンタル酵母社製MF飼料)を用い、これにコーヒー生豆抽出物を0.5%、1%及び2%配合して試験食とした。食餌を2週間自由摂食させた後、代謝ケージに移し、4日間に渡って尿、糞便を採取して鉄、亜鉛、カルシウム及びマグネシウムの出納試験を実施した。また、最終日に採血して血清中の鉄、亜鉛、カルシウム及びマグネシウム濃度を測定した。ミネラル類の検出には誘導結合プラズマ発光分光法(糞便)、原子吸光法(尿)、比色法及び原子吸光法(血清)を用いた。また、以下の示す計算式を用いてミネラル類の吸収率及び体内保留率を算出した。

[0022]

吸収量 = 摂取量-糞便中排泄量

消化吸収率(%)=吸収量÷摂取量×100

体内保留量 =吸収量-尿中排泄量

体内保留率 (%) =体内保留量÷摂取量×100

[0023]

<統計解析> 数値は平均値±標準偏差 (n=5) で表した。分散分析を行って有意なF値 (p<0.05) が得られることを確認した後、Fisher's PLSD法によるpost hocテストを実施した。

$[0\dot{0}24]$

<結果> 出納試験期間中のミネラル類の消化吸収率(表1)及び体内保留率(表2)はコーヒー生豆抽出物の摂取量依存的な増加傾向を認めた。また、血清中

のカルシウム、鉄及び亜鉛濃度はコントロール食に比較してコーヒー生豆抽出物 配合食で高い傾向を認めた(表3)。

[0025]

【表1】

ミネンル浦化吸収率				
	Fe消化吸収率	Zn消化吸収率	Ca消化吸収率	Mg消化吸収率
	(%)	(%)	(%)	(%)
コントロール食	25.1 ± 2.8	6.9 ± 7.3	21.4 ± 5.1	12. 4 ± 8.2
0.5%コーヒー生豆抽出物配合食	34.3 ± 0.8	11.4 ± 7.3	26.8 ± 8.5	17.5 \pm 7.5
1.0%コーヒー生豆抽出物配合食	35.0 ± 1.9 **	26.1 \pm 11.2**	$31.4\pm5.0^{*}$	22.1 ± 7.7
2.0%コーヒー生豆抽出物配合食	33. 6 ± 2 . 7^{**}	23.6 \pm 8.5**	29.1 \pm 5.6	20.5±7.7
Mean±SD(n=5), *p<0.05, **p<0.01 vs. コントロール食	0.01 vs. ⊐ント	ロール食		

[0026]



ミネラル体内保留率

	Fe体内保留率	Zn体内保留率	Ca体内保留率	Mg体内保留率
	(%)	(%)	%	(%)
コントロール食	22.2 ± 5.1	5.1±1.5	20.9 ± 5.1	9.1 ± 6.9
0.5%コーヒー生豆抽出物配合食	$32.2\pm5.5**$	6.8 ± 7.6	26.6 ± 8.5	16.9 ± 7.6
0%コーヒー	31. 7 ± 4.0^{4}	19.5 \pm 11.0**	$30.8\pm5.0^{\circ}$	$20.1 \pm 7.0^{*}$
2.0%コーヒー生豆抽出物配合食	$30.8\pm6.3^*$	17.4 ± 9.3 **	28.7 ± 5.6	18.5 ± 8.2

Mean±SD(n=5), *p<0.05, **p<0.01 vs. コントロール食

[0027]



血清ミネラル濃度

	Fe濃度	Zn濃度	Ca濃度	Mg濃度
	$(\mu g/dl)$	$(\mu g/dI)$	(mg/d1)	(mg/d1)
コントロール食	189.0 ± 66.7	108.4 ± 7.9	10. 70 ± 0.14	1.98±0.13
0.5%コーヒー生豆抽出物配合食	$295.2 \pm 99.3^{*}$	108.8 ± 14.5	10. 54 ± 0.21	1.82 \pm 0.35
1.0%コーヒー生豆抽出物配合食	228.4 ± 54.2	119.8 \pm 13.3	10. 56 ± 0.32	2.02 ± 0.08
2.0%コーヒー生豆抽出物配合食	255.4 ± 53.4	$125.0\pm6.8^{*}$	11. $10 \pm 0.25^*$	2.08 ± 0.19

Mean±SD(n=5), *p<0.05, **p<0.01 vs. コントロール食

[0028]

【発明の効果】

本発明のミネラル吸収促進剤を摂取することにより、食品中に含まれるミネラル類の消化吸収率あるいは体内保留率が有意に増大することから、優れたミネラ



吸収促進作用が発揮され、ミネラル不足に伴う体調不良や疾病などの予防・改作用を有する食品・医薬組成物を提供することができる。

書類名】

要約書

要約】

【課題】 安全性に優れ、かつ優れたミネラル吸収促進作用を有し、ミネラル不足を解消することができるミネラル吸収促進剤の提供。

【解決手段】 コーヒー生豆抽出物を含有するミネラル吸収促進剤。

【選択図】 なし



認定・付加情報

特許出願の番号 特願2002-342134

受付番号 50201782980

書類名 特許願

担当官 松野 邦昭 2209

作成日 平成14年11月28日

<認定情報・付加情報>

【提出日】 平成14年11月26日



特願2002-342134

出願人履歴情報

識別番号

[000000918]

1. 変更年月日

1990年 8月24日 新規登録

[変更理由]

新規登録

住 所

東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番10号

花王株式会社

氏 名